PCT

国際事務局



特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(51) 国際特許分類6

C07D 277/56, 417/12, A61K 31/425,

(11) 国際公開番号

WO96/36619

31/44, 31/445, 31/495

(43) 国際公開日

1996年11月21日(21.11.96)

(21) 国際出願番号 (22) 国際出願日

1996年5月16日(16.05.96)

PCT/JP96/01297

JР

A1

弁理士 有賀三幸, 外(ARUGA, Mitsuyuki et al.)

共同ビル Tokyo, (JP)

(30) 優先権データ

特額平7/142399

1995年5月18日(18.05.95)

(71) 出願人(米国を除くすべての指定国について)

ゼリア新薬工業株式会社

(ZERIA PHARMACEUTICAL CO., LTD.)[JP/JP]

-〒103 東京都中央区日本橋小舟町10番11号 Tokyo, (JP)

(72) 発明者;および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ)

長澤正明(NAGASAWA, Masaaki)[JP/JP]

村田正和(MURATA, Masakazu)[JP/JP]

西岡裕康(NISHIOKA, Hiroyasu)[JP/JP]

栗本 忠(KURIMOTO, Tadashi)[JP/JP]

上木 茂(UEKI, Shigeru)[JP/JP]

北川 治(KITAGAWA, Osamu)[JP/JP]

〒360-01 埼玉県大里郡江南町大字押切字沼上2512-1

ゼリア新薬工業株式会社 中央研究所内 Saitama, (JP)

(74) 代理人

〒103 東京都中央区日本橋人形町1丁目3番6号

(81) 指定国

AU, CA, CN, JP, KR, US, 欧州特許(AT, BE, CH, DE, DK, ES,

FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE).

添付公開書類

国際調査報告書

(54) Tide: AMINOTHIAZOLE DERIVATIVES, DRUG CONTAINING THE SAME AND INTERMEDIATE IN THE PRODUCTION OF THE COMPOUNDS

(54) 発明の名称 アミノチアゾール誘導体、それを含有する医薬及び該化合物の製造中間体

$$R^{2} \xrightarrow{R^{1}} \frac{0}{N} + \frac{1}{N} + \frac{1}{N} = \frac{1}{N} + \frac{1}{N} +$$

(57) Abstract

An aminothiazole derivative represented by general formula (I), wherein R¹, R² and R³ represent each hydrogen, hydroxy, lower alkyl, lower alkoxy, etc.; R⁴ represents hydrogen or lower alkyl; R⁵ represents hydrogen, halogeno or lower alkyl; m is an integer of from 0 to 4; A represents substituted amino, substituted imino, a heterocycle, etc.; and B represents imino or oxygen. Because of having a potent effect of promoting the movements of the digestive tracts and a high safety, the compound is useful as an excellent drug for ameliorating the movements of the digestive

(57) 要約



本発明は一般式(1)

$$R^{2} \xrightarrow{R^{1}} \frac{0}{R^{3}} \times \frac{1}{R^{4}} \times \frac{1}{N} \times \frac$$

(式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 は水素原子、ヒドロキシ基、低級アルキル基、低級アルコキシ基等を示し、 R^4 は水素原子又は低級アルキル基を示し、 R^5 は水素原子、ハロゲン原子又は低級アルキル基を示し、 R^5 は水素原子、ハロゲン原子又は低級アルキル基を示し、 R^5 は水素原子、 R^5 は水素原子を示し、 R^5 は水素原子を示し、 R^5 は水素原子を示す。)

で表されるアミノチアゾール誘導体、それを含有する医薬及び該化合物の製造中間体に関する。本発明の化合物は強い消化管運動亢進作用を有し、かつ安全性も高いことから優れた消化管運動改善剤として有用である。

情報としての用途のみ PCTに基づいて公開される国際出願をパンフレット第一頁にPCT加盟国を同定するために使用されるコード

GABENRUELSTPEGBBRY A サールイドーナアファイン・アイン・アイン・アイン・アイン・アイン・アイン・アイン・アイン・アイン・ア	アイルランド	LLLLLLLLLLLLLLLLLLLLLLLLLLLLLLLLLLLL	PPRRSSSSSSSSTTTTTTTUUUUV	ポポルロススシススセスチトタトトトウウアウヴールーシーウンロロネワャージルルリクガメズィールーシーウンロロネワャージルルリクガメズィールーシーウンロロネワャージルルリクガメズィールーシーウンロロネワマージー メッケー クス・ケーク クス・ケーク クス・ケーク クス・ケーク クス・ケーク クス・ケーク クス・ケーク クス・ケーク アイグル・カー・カー・カー・カー・カー・カー・カー・カー・カー・カー・カー・カー・カー・
---	--------	--------------------------------------	--------------------------	---

明 細 書

アミノチアゾール誘導体、それを含有する医薬及び該化合物の製造中間体

技術分野

本発明は、消化管運動改善作用を有する新規なアミノチアゾール誘導体、それを含有する医薬及び該化合物の製造中間体に関する。

背景技術

従来、消化管運動障害の治療剤としては、ドンペリドン、メトクロプラミド等の抗ドパミン薬、マレイン酸トリメブチン等のオピエート作動薬、シサプリド等の $5\,H\,T_3$ 拮抗・ $5\,H\,T_4$ 作動薬、塩化アセチルコリン等のアセチルコリン作動薬等が臨床に用いられている。また、このほかにも消化管運動障害の治療を目的として数多くの消化管運動改善剤の探索がなされている(特開平 $1-3\,1\,3\,4\,2\,4\,$ 号公報、特開平 $3-1\,6\,3\,0\,7\,4\,$ 号公報、特開平 $4-2\,7\,9\,5\,8\,1\,$ 号公報)。しかしながら、必ずしも十分な消化管運動改善作用をもたらすものはなく、また十分な効果を有する薬剤であっても前記各作用機序に起因する副作用が懸念され、必ずしも満足のいくものではなかった。したがって、消化管運動改善作用に優れかつ副作用を軽減した薬剤の開発が望まれていた。

発明の開示

本発明者らは、かかる実情に鑑み鋭意検討した結果、特定のアミノチアゾール 誘導体が優れた消化管運動改善作用を有し、副作用も少ないことを見出し、本発 明を完成した。

すなわち、本発明は下記一般式 ([)